



## PATENT COOPERATION TREATY

## PCT

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

518,788

Applicant's or agent's file reference YCT-853	FOR FURTHER ACTION	See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)
International application No. PCT/JP2003/010160	International filing date (day/month/year) 08 August 2003 (08.08.2003)	Priority date (day/month/year) 09 August 2002 (09.08.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07H 15/20, 15/203, A61K 31/7034, 45/06, A61P 3/10, 13/12, 43/00		

Applicant

TAISHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.
2. This REPORT consists of a total of 5 sheets, including this cover sheet.

This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).

These annexes consist of a total of \_\_\_\_\_ sheets.

3. This report contains indications relating to the following items:

- I  Basis of the report
- II  Priority
- III  Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- IV  Lack of unity of invention
- V  Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- VI  Certain documents cited
- VII  Certain defects in the international application
- VIII  Certain observations on the international application

Date of submission of the demand

30 October 2003 (30.10.2003)

Date of completion of this report

13 January 2004 (13.01.2004)

Name and mailing address of the IPEA/JP

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/JP2003/010160

## I. Basis of the report

## 1. With regard to the elements of the international application:\*

the international application as originally filed

the description:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the demand  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_

the claims:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed  
 pages \_\_\_\_\_, as amended (together with any statement under Article 19)  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the demand  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_

the drawings:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the demand  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_

the sequence listing part of the description:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the demand  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_

## 2. With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item.

These elements were available or furnished to this Authority in the following language \_\_\_\_\_ which is:

the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)).  
 the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).  
 the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).

## 3. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:

contained in the international application in written form.  
 filed together with the international application in computer readable form.  
 furnished subsequently to this Authority in written form.  
 furnished subsequently to this Authority in computer readable form.  
 The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.  
 The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.

4.  The amendments have resulted in the cancellation of:

the description, pages \_\_\_\_\_  
 the claims, Nos. \_\_\_\_\_  
 the drawings, sheets/fig. \_\_\_\_\_

5.  This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).\*\*

\* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16 and 70.17).

\*\* Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.  
PCT/JP 03/10160

## V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

## 1. Statement

Novelty (N)	Claims	1-18	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	Claims	1-18	YES
	Claims		NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-18	YES
	Claims		NO

## 2. Citations and explanations

This explanation of the written opinion was drafted based upon the disclosures in the following documents, which are cited in the international search report.

Document 1: WO 01/16147 A1 (Kissei Pharmaceutical Co., Ltd.)

Document 2: WO 01/68660 A1 (Kissei Pharmaceutical Co., Ltd.)

Document 3: WO 01/74834 A1 (Bristol-Myers Squibb Co.)

Document 4: WO 01/74835 A1 (Bristol-Myers Squibb Co.)

Document 5: WO 02/053573 A1 (Kissei Pharmaceutical Co., Ltd.)

Document 6: WO 02/36602 A1 (Ajinomoto Co., Inc.)

Document 7: JP 10-237089 A (Tanabe Seiyaku Co., Ltd.)

Document 8: E. BOZO et al., Carbohydrate Research, 1998, 311, pages 191-202

Document 9: H. YUASA et al., Agnes. Chem. Int. Ed. Engl., 1997, 36 (8), pages 868-870

Document 10: K. D. RANDELL et al., Carbohydrate Research, 1999, 321, pages 143-156

## Claims 1-18

Documents 1-5 disclose medicaments comprising a compound such as a glucopyranosyl oxypyrazole derivative, which exhibits an action whereby it inhibits the activity of human SGLT2, as an active component. In addition, document 6 discloses therapeutic drugs against diabetes, which comprise a pyrazole-0-glycoside derivative as an active component, and document 7 discloses therapeutic drugs against diabetes, which comprise a propiophenon derivative as an active component. Therein, a comparison of the inventions that are set forth in claims 1-18 and the inventions that are disclosed in documents 1-7 shows that the former inventions have a 5-thio- $\beta$ -D-glucopyranoside structure, whereas the latter inventions have a  $\beta$ -D-pyranoside structure; therefore, they are different.

Meanwhile, documents 8-10 disclose compounds that have a 5-thio- $\beta$ -D-glucopyranoside structure. However, document 8 merely presents the synthetic chemical profiles of the compounds that are disclosed therein, and does not make any disclosures pertaining to the pharmacological activity of the compounds as medicaments. In addition, document 9 presents compounds that are related to a medicament; however, document 9 indicates that said compounds exhibit an anti-thrombosis action, which is significantly different from the treatment of diabetes as disclosed in documents 1-7. Furthermore, document 10 presents compounds related to inhibiting the biosynthesis of sugars; however, the content disclosed in document 10 is completely unrelated to the feature of inhibiting the re-uptake of glucose, which is the mechanism for treating diabetes that is disclosed in documents 1-7. Consequently, it cannot be said to be easy for even a person skilled in the art to conceive of the inventions that are set forth in claims 1-18 in the light of the disclosures of

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/ [REDACTED] 03/10160

documents 1-10.

Therefore, the inventions that are set forth in claims 1-18 involve an inventive step in relation to documents 1-10.

## 特許協力条約

発信人 日本国特許庁（国際予備審査機関）

10/518788

出願人代理人

社 本 一 夫 殿

PCT

あて名

〒 100-0004  
東京都 千代田区  
大手町二丁目 2番1号  
新大手町ビル 206区  
ユアサハラ法律特許事務所

国際予備審査報告の送付の通知書

(法施行規則第57条)  
(PCT規則71.1)

発送日  
(日.月.年)

27. 1. 2004

出願人又は代理人  
の書類記号 YCT-853

重要な通知

国際出願番号 PCT/JPO3/10160	国際出願日 (日.月.年) 08.08.2003	優先日 (日.月.年) 09.08.2002
--------------------------	-----------------------------	---------------------------

出願人（氏名又は名称）  
大正製薬株式会社

1. 国際予備審査機関は、この国際出願に関して国際予備審査報告及び付属書類が作成されている場合には、それらをこの送付書とともに送付することを、出願人に通知する。
2. 国際予備審査報告及び付属書類が作成されている場合には、すべての選択官庁に通知するために、それらの写しを国際事務局に送付する。
3. 選択官庁から要求があったときは、国際事務局は国際予備審査報告（付属書類を除く）の英語の翻訳文を作成し、それをその選択官庁に送付する。
4. 注意

出願人は、各選択官庁に対し優先日から30月以内に（官庁によってはもっと遅く）所定の手続（翻訳文の提出及び国内手数料の支払い）をしなければならない（PCT39条（1））（様式PCT/IB/301とともに国際事務局から送付された注を参照）。

国際出願の翻訳文が選択官庁に提出された場合には、その翻訳文は、国際予備審査報告の付属書類の翻訳文を含まなければならない。

この翻訳文を作成し、関係する選択官庁に直接送付するのは出願人の責任である。

選択官庁が適用する期間及び要件の詳細については、PCT出願人の手引き第II巻を参照すること。

名称及びあて名 日本国特許庁（IPEA/JP） 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	権限のある職員 特許庁長官	4C 9736
電話番号 03-3581-1101 内線 3450		

Rec'd PCT/PPO 21 DEC 2004

10/53788

## 特許協力条約

PCT

国際予備審査報告

REC'D 03 FEB 2004

WIPO PCT

(法第12条、法施行規則第56条)  
〔PCT36条及びPCT規則70〕

出願人又は代理人 の審査記号 YCT-853	今後の手続きについては、国際予備審査報告の送付通知（様式PCT/IPEA/416）を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JPO3/10160	国際出願日 (日.月.年) 08.08.2003	優先日 (日.月.年) 09.08.2002
国際特許分類 (IPC) Int.Cl' C07H15/20, 15/203, A61K31/7034, 45/06, A61P3/10, 13/12, 43/00		
出願人（氏名又は名称） 大正製薬株式会社		

1. 国際予備審査機関が作成したこの国際予備審査報告を法施行規則第57条（PCT36条）の規定に従い送付する。

2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 3 ページからなる。

この国際予備審査報告には、附属書類、つまり補正されて、この報告の基礎とされた及び／又はこの国際予備審査機関に対して訂正を含む明細書、請求の範囲及び／又は図面も添付されている。  
(PCT規則70.16及びPCT実施細則第607号参照)

この附属書類は、全部で        ページである。

3. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

- I  国際予備審査報告の基礎
- II  優先権
- III  新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
- IV  発明の単一性の欠如
- V  PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- VI  ある種の引用文献
- VII  国際出願の不備
- VIII  国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 30.10.2003	国際予備審査報告を作成した日 13.01.2004
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号 100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官（権限のある職員） 荒木 英則 電話番号 03-3581-1101 内線 3450
	4C 9736

## I. 国際予備審査報告の基礎

1. この国際予備審査報告は下記の出願書類に基づいて作成された。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差し替え用紙は、この報告書において「出願時」とし、本報告書には添付しない。  
PCT規則70.16, 70.17)

 出願時の国際出願書類

<input type="checkbox"/> 明細書	第 _____	ページ、	出願時に提出されたもの
<input type="checkbox"/> 明細書	第 _____	ページ、	国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
<input type="checkbox"/> 明細書	第 _____	ページ、	付の書簡と共に提出されたもの
<input type="checkbox"/> 請求の範囲	第 _____	項、	出願時に提出されたもの
<input type="checkbox"/> 請求の範囲	第 _____	項、	PCT19条の規定に基づき補正されたもの
<input type="checkbox"/> 請求の範囲	第 _____	項、	国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
<input type="checkbox"/> 請求の範囲	第 _____	項、	付の書簡と共に提出されたもの
<input type="checkbox"/> 図面	第 _____	ページ/図、	出願時に提出されたもの
<input type="checkbox"/> 図面	第 _____	ページ/図、	国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
<input type="checkbox"/> 図面	第 _____	ページ/図、	付の書簡と共に提出されたもの
<input type="checkbox"/> 明細書の配列表の部分	第 _____	ページ、	出願時に提出されたもの
<input type="checkbox"/> 明細書の配列表の部分	第 _____	ページ、	国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
<input type="checkbox"/> 明細書の配列表の部分	第 _____	ページ、	付の書簡と共に提出されたもの

2. 上記の出願書類の言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願の言語である。

上記の書類は、下記の言語である \_\_\_\_\_ 語である。

国際調査のために提出されたPCT規則23.1(b)にいう翻訳文の言語  
 PCT規則48.3(b)にいう国際公開の言語  
 国際予備審査のために提出されたPCT規則55.2または55.3にいう翻訳文の言語

3. この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際予備審査報告を行った。

この国際出願に含まれる書面による配列表  
 この国際出願と共に提出された磁気ディスクによる配列表  
 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された書面による配列表  
 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された磁気ディスクによる配列表  
 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった  
 書面による配列表に記載した配列と磁気ディスクによる配列表に記録した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

4. 補正により、下記の書類が削除された。

明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ  
 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項  
 図面 図面の第 \_\_\_\_\_ ページ/図

5.  この国際予備審査報告は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c) この補正を含む差し替え用紙は上記1.における判断の際に考慮しなければならず、本報告に添付する。)

## V. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条 (PCT35条(2)) に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

## 1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲	1-18	有
	請求の範囲		無
進歩性 (IS)	請求の範囲	1-18	有
	請求の範囲		無
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲	1-18	有
	請求の範囲		無

## 2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

見解に対する説明は、国際調査報告で引用された以下の文献の記載に基づいて示される。

文献1: WO 01/16147 A1 (キッセイ薬品工業株式会社)  
 文献2: WO 01/68660 A1 (キッセイ薬品工業株式会社)  
 文献3: WO 01/74834 A1 (BRISTOL-MYERS SQUIBB COMPANY)  
 文献4: WO 01/74835 A1 (BRISTOL-MYERS SQUIBB COMPANY)  
 文献5: WO 02/053573 A1 (キッセイ薬品工業株式会社)  
 文献6: WO 02/36602 A1 (味の素株式会社)  
 文献7: JP 10-237089 A (田辺製薬株式会社)  
 文献8: BOZO, E., et al. Carbohydrate Research, 1998, 311, pp. 191-202  
 文献9: YUASA, H. et al. Angew. Chem. Int. Ed. Engl., 1997, 36(8), pp. 868-870  
 文献10: RANDELL, K. D., et al. Carbohydrate Research, 1999, 321, pp. 143-156

## ○請求の範囲1-18について

文献1から5には、ヒトSGLT2活性阻害作用を有する、グルコピラノシルオキシピラゾール誘導体等の化合物を有効成分とする医薬について記載されている。また、文献6にはピラゾール-0-グリコシド誘導体を有効成分とする糖尿病治療薬が記載され、文献7にはプロピオフェノン誘導体を有効成分とする糖尿病治療薬が記載されている。ここで、請求の範囲1から18に係る発明と文献1から7に記載されたものとを比較すると、前者は5-チオ- $\beta$ -D-グルコピラノシド構造を有するものであるのに対し、後者は $\beta$ -D-ピラノシド構造を有するものである点で相違する。

ところで、文献8から10には5-チオ- $\beta$ -D-グルコピラノシド構造を有する化合物が記載されている。しかしながら、文献8に記載のものはその合成化学的側面を述べたに過ぎず、医薬としての生理活性については何ら記載されていない。また、文献8のものは医薬に関するものであるが、その作用とは抗血栓であり、文献1から7に記載の糖尿病治療とは大きく異なるものである。更に、文献10に記載のものは糖の生合成阻害に関するものであるが、文献1から7に記載の糖尿病治療の機序である、グルコース再吸収の阻害とはその内容が全く異なるものである。してみれば、当業者といえども、文献1から10の記載によっては請求の範囲1から18に係る発明に想到することが容易であるとはいえない。

よって、請求の範囲1から18に係る発明は、文献1から10によっても進歩性を有するものである。